



УКРАЇНА

(19) UA (11) 82124 (13) C2

(51) МПК (2006)

C07D 213/42 (2006.01)

A01N 43/40 (2007.01)

A01P 3/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ПОХІДНІ СУЛЬФОНАМІДУ, СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ЗАСІБ НА ЇХ ОСНОВІ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ  
З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ

1

2

(21) а200604147

(22) 10.09.2004

(24) 11.03.2008

(86) РСТ/ЕР2004/010124, 10.09.2004

(31) 03021098.3

(32) 18.09.2003

(33) ЕР

(72) ГРАММЕНОС ВАССИЛІОС, GR/DE, БЛЕТТНЕР  
КАРСТЕН, МЮЛЛЕР БЕРНД, ГЕВЕР МАРКУС,  
ТОРМО І БЛАСКО ЙОРДІ, ES/DE, ГРОТЕ ТОМАС,  
РАЙНХАЙМЕР ЙОАХИМ, ШЕФЕР ПЕТЕР, ШІВЕК  
ФРАНК, ШВЬОГЛЕР АНЯ, ВАГНЕР ОЛІВЕР,  
ГЬОТЦ НОРБЕРТ, ШТРАТМАНН ЗІГФРИД,  
ШЬОФЛЬ УЛЬРІХ, ШЕРЕР МАРІА, ШТІРЛЬ  
РАЙНХАРД

(73) БАСФ АКЦІЄНГЕЗЕЛЬШАФТ

(56) US 4 874 775, A, 17.10.1989

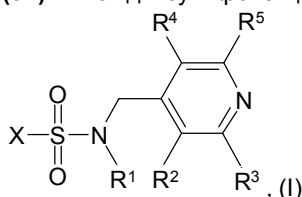
EP 1 174 028, A1, 23.01.2002

US 4 699 652, A, 13.10.1987

GB 2 078 215, A, 06.01.1982

WO 0006083, A, 10.02.2000

(57) 1. Похідні сульфонамідів формули I



у якій замісники мають наступні значення:

R<sup>1</sup> означає водень, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкініл або бензил;R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> незалежно один від одного означають водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси або C<sub>1</sub>-галогенметил;R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> можуть також спільно утворювати фенільне, циклопентильне або циклогексильне кільце, причому ці кільця можуть мати дві групи R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup>;R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> незалежно один від одного означають водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси або C<sub>1</sub>-галогенметил;у випадку а), якщо R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> означають водень,X означає феніл, що може бути заміщений однією групою -C(R<sup>6</sup>) = NOR<sup>7</sup>, деR<sup>6</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл таR<sup>7</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, бензил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкініл або C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкініл; іу випадку б), якщо принаймні одна з груп R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> не означає водень,X означає феніл, нафтил або п'яти- або шестичленний, приєднаний С-атомом, насичений, частково ненасичений або ароматичний гетероцикл, що містить від одного до чотирьох гетероатомів з групи, яка включає О, N або S, причому X може мати від однієї до чотирьох груп R<sup>a</sup>:R<sup>a</sup> означає галоген, ціано, нітро, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбоніл, -C(R<sup>6</sup>) = NOR<sup>7</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіламінокарбоніл, ді-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл)амінокарбоніл або феніл, або фенокси, причому кільця можуть мати від однієї до трьох груп R<sup>b</sup>:R<sup>b</sup> означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-галогеналкіл або C<sub>1</sub>-галогеналкокси;R<sup>a</sup> або R<sup>b</sup> може означати також і C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-алкіленову або C<sub>4</sub>-алкіленову групу, що утворює з двома суміжними кільцевими членами фенільного кільця, до якого вона приєднана, кільце, яке може бути заміщено однією або декількома вищенаведеними групами R<sup>a</sup> або R<sup>b</sup>.2. Сполуки формули I за п. 1, які відрізняються тим, що R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> незалежно один від одного означають водень, метил, фтор, хлор, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> або OCHF<sub>2</sub>.3. Сполуки формули I за п. 1 або 2, які відрізняються тим, що R<sup>1</sup> означає водень, метил, метокси, етокси, аліл або пропаргіл.

4. Сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-3, які відрізняються тим, що X означає фенільне кільце, заміщене в пара-положенні.

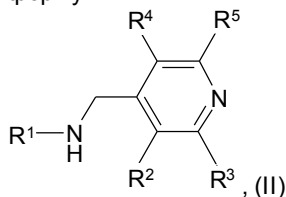
5. Сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-3, які відрізняються тим, що X означає ароматичний гетероцикл.

(13) C2

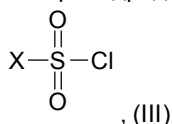
(11) 82124

(19) UA

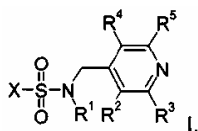
6. Спосіб одержання сполук формули I за будь-яким з пп. 1-5 взаємодією похідних піримідину формули II



у якій перемінні мають значення, згадане у п. 1, з хлорангідридами сульфокислоти формули III



Даний винахід стосується сульфонамідів формули I



у якій замісники мають наступні значення:

$R^1$  означає водень,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_2$ - $C_4$ -алкеніл,  $C_2$ - $C_4$ -алкініл або бензил;

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  незалежно один від одного означають водень, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси або  $C_1$ -галогенметил;

$R^2$  та  $R^3$  можуть також спільно утворювати фенільне, цикlopентильне або циклогексильне кільце, причому ці кільця можуть мати дві групи  $R^{2'}$  та  $R^{3'}$ ;

$R^{2'}$ ,  $R^{3'}$  незалежно один від одного означають водень, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси або  $C_1$ -галогенметил;

у випадку а), якщо  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  та  $R^5$  означають водень,

X означає феніл, який може бути заміщений групою  $-C(R^6)=NOR^7$ , де

$R^6$  означає  $C_1$ - $C_4$ -алкіл та

$R^7$  означає  $C_1$ - $C_8$ -алкіл, бензил,  $C_2$ - $C_4$ -алкеніл,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкіл,  $C_2$ - $C_4$ -галогеналкеніл,  $C_2$ - $C_4$ -алкініл або  $C_2$ - $C_4$ -галогеналкініл; та

у випадку б), якщо, принаймні, одна з груп  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  та  $R^5$  не означає водень,

X означає феніл, нафтил або п'яти- або шестичленний, приєднаний С-атомом, насичений, частково ненасичений або ароматичний гетероцикл, який містить від одного до чотирьох гетероатомів, що вибрані з групи, яка включає О, N або S, причому X може мати від однієї до чотирьох груп  $R^a$ ;

$R^a$  означає галоген, ціано, нітро,  $C_1$ - $C_8$ -алкіл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілкарбоніл,  $C_1$ - $C_4$ -алкоксикарбоніл,  $-C(R^6)=NOR^7$ ,  $C_1$ - $C_4$ -алкіламінокарбоніл, ди- $(C_1$ - $C_4$ -алкіл)амінокарбоніл або феніл або фенокси, причому кільця можуть мати від однієї до трьох груп  $R^b$ ;

у якій X має значення, згадане у п. 1, у присутності основи.

7. Придатний для боротьби з патогенними грибами засіб, який містить твердий або рідкий наповнювач і сполуку за п. 1.

8. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, який **відрізняється** тим, що гриби або матеріали, рослини, ґрунт або посівний матеріал, що підлягають захисту від ураження ними, обробляють ефективною кількістю сполуки формули I за п. 1.

$R^b$  означає галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ -галогеналкіл або  $C_1$ -галогеналкокси;

$R^a$  або  $R^b$  може означати також і  $C_3$ - $C_4$ -алкіленову або  $C_4$ -алкеніленову групу, яка утворює з двома суміжними кільцевими членами фенільного кільця, до якого вона приєднана, кільце, яке може бути заміщено однією або декількома вищенаведеними групами  $R^a$  або  $R^b$ .

Крім того, винахід стосується способу одержання таких сполук, засобів, які їх містять, а також їх застосування для боротьби з фітопатогенними грибами.

У [заявках DE-A 3122700 та WO 00/06083] у загальних рисах описуються піридинсульфонаміди як фармацевтичні засоби. У загальний зміст цих документів включені 4-піридинметилсульфонаміди.

З [європейської заявки EP-A 206581 та з публікації Lieb. Ann. Chem. 641 (1990)] відомі окремі 4-піридинметилсульфонаміди. Описані в названих документах сполуки придатні для боротьби з патогенними грибами.

Однак їх дія в багатьох випадках є незадовільною. Виходячи з цього в основу даного винаходу покладена задача розробити сполуки з поліпшеною дією і/або більш широким спектром дії.

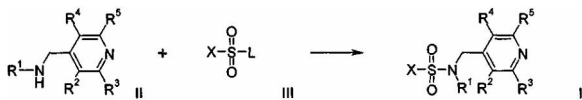
Відповідно до цього були розроблені вищенаведені сполуки, далі були розроблені спосіб та проміжні продукти для їх одержання, засоби, що їх містять, а також спосіб боротьби з патогенними грибами при застосуванні сполук формули I.

Сполуки відповідно до винаходу відрізняються від описаних у [документах EP-A 206581, DE-A 3122700 та WO 00/06083] сполук 4-піридинометильною групою та від відомих з [публікації Lieb. Ann. Chem. 641 (1990)] сполук заміщенням піридинового кільця, відповідно, групи X.

Сполуки формули I мають підвищену ефективність у порівнянні з відомими сполуками.

Сполуки відповідно до винаходу можуть бути одержані різним чином. Переважно їх одержують, виходячи з похідних піримідину формули II, їх

взаємодією з сульфокислотами або активованими похідними сульфокислот формули III, де X має значення відповідно до п.1 формули винаходу, у присутності основи. У формулі III L означає гідрокси або галоген, бажано хлор.



Цю взаємодію здійснюють звичайно при температурі від  $-30^{\circ}\text{C}$  до  $120^{\circ}\text{C}$ , бажано, від  $-10^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ , в інертному органічному розчиннику в присутності основи [порівн. публікацію Lieb. Ann. Chem. 641 (1990)].

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та петролейний ефір, ароматичні вуглеводні, такі, як толуол, о-, м- та п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ та хлорбензол, прості ефіри, такі, як диметиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол та тетрагідрофуран, нітрили, такі, як ацетонітрил і пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон та трет-бутилметилкетон, а також диметилсульфоксид, диметилформамід і диметилацетамід, зокрема діізопропіловий ефір, діетиловий ефір і тетрагідрофуран. Можуть також застосовуватися суміші названих розчинників.

Як основи загалом придатні неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію та оксид магнію, гідриди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, карбонати лужних та лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, триізопропілетиламін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, а також біциклічні аміни. Особливо кращі піридин, триетиламін та карбонат калію. Основи застосовуються звичайно в каталітичній кількості, однак вони можуть застосовуватися і в еквімолярній кількості, у надлишку або, в разі потреби, як розчинник.

Вихідні продукти загалом піддають взаємодії один з одним в еквімолярній кількості. Для одержання високого виходу кращим є застосування сполуки II у надлишку, у перерахунку на сполуку III.

Необхідні для одержання сполук I вихідні речовини можуть бути придбані на ринку або відомі з літературних джерел [див. публікації J. fur praktische Chemie, S. 695 (1994); Heterocycles, S. 675 (1995); Tetrahedron, S. 12483 (1996); Chem. Pharm. Bull., S. 1927 (1973); J. Chem. Soc, S. 426 (1942); EP-A 983 982; Synthesis, S. 852 (1986)] або

можуть бути одержані відповідно до методів, які процитовані в них.

Реакційні суміші звичайно переробляють, наприклад, змішуванням з водою, розділенням фаз та, в разі потреби, хроматографічним очищенням сирих продуктів. Проміжні або кінцеві продукти знаходяться, наприклад, у вигляді безбарвних або трошки коричнюватих, в'язких масел, які при зниженому тиску та при помірно високій температурі вивільняють від летких компонентів або очищають. Якщо проміжні та кінцеві продукти одержують у вигляді твердих речовин, очищення можна здійснювати перекристалізацією або дигеруванням.

Якщо окремі сполуки I не можуть бути одержані вищенаведеним чином, вони можуть бути одержані шляхом заміни радикалів (дериватизацією) з інших сполук I.

Загалом, якщо при синтезі одержують ізомерні суміші, розділення на ізомери не обов'язково потрібне, тому що окремі ізомери частково під час переробки для застосування або при застосуванні (наприклад, під впливом світла, кислот або основ) перетворюються один в одного. Відповідні перетворення можуть відбуватися також і після застосування, наприклад, при обробці рослин, в оброблюваній рослині або в патогенному грибі, який підлягає знищенню.

При зазначених у нижченаведених формулах визначеннях символів застосовуються збірні поняття, які загалом дійсні для наступних замісників, причому:

галоген: означає фтор, хлор, бром та йод;

алкіл: означає розгалужені або нерозгалужені вуглеводневі залишки з числом атомів вуглецю від 1 до 4, 6 або 8, наприклад,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -алкіл, такий, як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл;

галогеналкіл: розгалужені або нерозгалужені алкільні групи з числом атомів вуглецю від 1 до 2 або 4 (як наведено вище), причому в цих групах атоми водню можуть бути частково або повністю заміщені атомами галогену, як наведено вище, зокрема  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -галогеналкіл, такий, як хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-бромметил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил або 1,1,1-трифторпроп-2-іл;

алкеніл: ненасичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводні з числом атомів вуглецю від 2 до 4, 6 або 8 та одним або двома подвійними

зв'язками в будь-якому положенні, наприклад,  $C_2$ - $C_6$ -алкеніл, такий, як етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл;

галогеналкеніл: ненасичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки з числом атомів вуглецю від 2 до 6 та одним або двома подвійними зв'язками в кожному (як наведено вище), причому в цих групах атоми водню можуть бути частково або повністю заміщені атомами галогену, як наведено вище, зокрема, фтором, хлором та бромом;

алкініл: нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі групи з числом атомів вуглецю від 2 до 4, 6 або 8 та одним або двома потрійними зв'язками в будь-якому положенні, наприклад,  $C_2$ - $C_6$ -алкініл, такий, як етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1,2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-бутиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-2-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл та 1-етил-1-метил-2-пропініл;

циклоалкіл: моно- або біциклічні насичені вуглеводневі групи з числом атомів вуглецю від 3 до 6 або 8, наприклад,  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл, такий як циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил та циклооктил;

п'яти- - десятичленний, насичений, частково ненасичений або ароматичний гетероцикл, який

містить від одного до чотирьох гетероатомів, що вибрані з групи, яка включає O, N або S:

- 5- або 6-членний гетероцикл, який містить від одного до трьох атомів азоту і/або один атом азоту або сірки або один або два атоми кисню і/або сірки, наприклад, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротієніл, 3-тетрагідротієніл, 2-піролідиніл, 3-піролідиніл, 3-ізоксазолідиніл, 4-ізоксазолідиніл, 5-ізоксазолідиніл, 3-ізотіазолідиніл, 4-ізотіазолідиніл, 5-ізотіазолідиніл, 3-піразолідиніл, 4-піразолідиніл, 5-піразолідиніл, 2-оксазолідиніл, 4-оксазолідиніл, 5-оксазолідиніл, 2-тіазолідиніл, 4-тіазолідиніл, 5-тіазолідиніл, 2-імідазолідиніл, 4-імідазолідиніл, 2-піролін-2-іл, 2-піролін-3-іл, 3-піролін-2-іл, 3-піролін-3-іл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, 1,3-діоксан-5-іл, 2-тетрагідропіраніл, 4-тетрагідропіраніл, 2-тетрагідротієніл, 3-гексагідропіридазиніл, 4-гексагідропіридазиніл, 2-гексагідропіримідиніл, 4-гексагідропіримідиніл, 5-гексагідропіримідиніл та 2-піперазиніл;

- 5-членний гетероарил, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню: 5-членні кільцеві гетероарил групи, які поряд з атомами вуглецю можуть містити від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню як члени кільця, наприклад, 2-тієніл, 3-тієніл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл та 1,3,4-тріазол-2-іл;

- 6-членний гетероарил, який містить від одного до трьох, відповідно, від одного до чотирьох атомів азоту: 6-членні кільцеві гетероарильні групи, які поряд з атомами вуглецю можуть містити від одного до трьох, відповідно, від одного до чотирьох атомів азоту як члени кільця, наприклад, 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл та 2-піразиніл;

алкілен: двовалентні нерозгалужені ланцюжки з 3-5  $CH_2$ -груп, наприклад,  $CH_2$ ,  $CH_2CH_2$ ,  $CH_2CH_2CH_2$ ,  $CH_2CH_2CH_2CH_2$  та  $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ ;

оксіалкілен: двовалентні нерозгалужені ланцюжки з 2-4  $CH_2$ -груп, причому одна валентність зв'язана зі скелетом атомом кисню, наприклад,  $OCH_2CH_2$ ,  $OCH_2CH_2CH_2$  та  $OCH_2CH_2CH_2CH_2$ ;

оксіалкіленокси: двовалентні нерозгалужені ланцюжки з 1-3  $CH_2$ -груп, причому обидві валентності зв'язані зі скелетом через атом кисню, наприклад,  $OCH_2O$ ,  $OCH_2CH_2O$  та  $OCH_2CH_2CH_2O$ ;

алкенілен: двовалентні нерозгалужені ланцюжки з 4 або 6  $CH$ -груп, які зв'язані через кон'юговані  $OC$ -подвійні зв'язки, наприклад,  $CH=CH$  або  $CH=CH-CH=CH$ .

В обсяг даного винаходу включені (R)- та (S)-ізомери та рацемати сполук формули I, які мають центри хіральності.

З урахуванням застосування відповідно до призначення сульфонамідів формули I особливо кращі наступні значення замісників, а саме для кожного окремо або в комбінації:

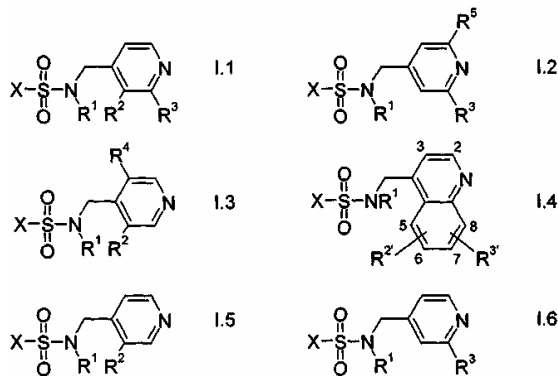
Сполуки формули I, у якій R<sup>1</sup> означає водень, метил, метокси, етокси, аліл або пропаргіл, зокрема водень або метил, являють собою кращій об'єкт винаходу.

Однаково кращі сполуки формули I, у якій R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> означають незалежно один від одного водень, метил, етил, фтор, хлор, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> або OCHF<sub>2</sub>.

Поряд з цим кращі також і сполуки формули I, де, принаймні, одна, зокрема одна або дві групи, вибрані з R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup>, неоднаково означають водень.

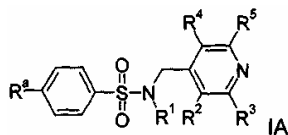
Також кращі сполуки формули I, які заміщені однією або двома групами, вибраними з R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup>.

Інші кращі форми виконання сполук формули I являють собою сполуки формул від I.1 до I.6, причому перемінні мають значення як для формули I:



Кращі сполуки формули I.4, у яких групи R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> перебувають у положеннях 6 та 7.

Особливо кращі сполуки формули I, у якій X означає фенільне кільце, яке має групу R<sup>a</sup> у пара-положенні, ці сполуки відповідають формулі IA:



Особливо кращі сполуки формули I, у яких R<sup>a</sup> має наступні значення: C(R<sup>6</sup>)=NOR<sup>7</sup>, метил, етил, н-пропіл, ізо-пропіл, н-бутил, ізо-бутил, втор-бутил, трет-бутил, метокси, етокси, н-пропокси, ізо-пропокси, н-бутокси, ізо-бутокси, втор-бутокси, трет-бутокси, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлордифторметокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2,2,2-трихлоретокси та пентафторетокси.

Особливо кращим значенням для R<sup>6</sup> є метил; R<sup>7</sup> означає бажано метил, етил, аліл та пропаргіл, причому групи R<sup>7</sup> можуть бути галогеновані.

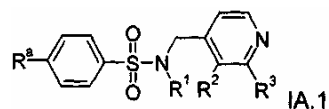
Особливо кращі з врахуванням їх застосування наступні наведені в нижченаведених таблицях сполуки формули I. Наведені в таблицях для одного замісника групи являють собою незалежно від комбінації, у якій вони наведені, особливо кращу форму виконання відповідного замісника.

Таблиця 1

Сполуки формули IA, у яких R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> означають водень та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку A-1 - A-14 таблиці A.

Таблиця 2

Сполуки формули IA.1, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означає метил та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A



Таблиця 3

Сполуки формули IA.1, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають фтор та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 4

Сполуки формули IA.1, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають хлор та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 5

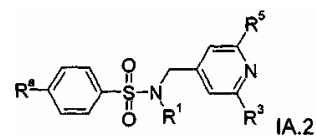
Сполуки формули IA.1, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають метокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 6

Сполуки формули IA.1, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають трифторметокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 7

Сполуки формули IA.2, у яких R<sup>3</sup> та R<sup>5</sup> означають метил та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A



Таблиця 8

Сполуки формули IA.2, у яких R<sup>3</sup> та R<sup>5</sup> означають фтор та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 9

Сполуки формули IA.2, у яких R<sup>3</sup> та R<sup>5</sup> означають хлор та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 10

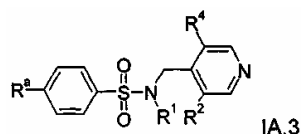
Сполуки формули IA.2, у яких R<sup>3</sup> та R<sup>5</sup> означають метокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 11

Сполуки формули IA.2, у яких R<sup>3</sup> та R<sup>5</sup> означають трифторметокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблиця 12

Сполуки формули ІА.3, у яких R<sup>2</sup> та R<sup>4</sup> означають метил та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці А



Таблиця 13

Сполуки формули 1А.3, у яких  $R^2$  та  $R^4$  означають фтор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 14

Сполуки формули ІА.3, у яких  $R^2$  та  $R^4$  означають хлор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 15

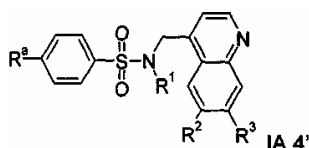
Сполуки формули ІА.3, у яких  $R^2$  та  $R^4$  означають метокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 16

Сполуки формули ІА.3, у яких  $R^2$  та  $R^4$  означають трифторметокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щонайменше одному рядку таблиці А.

Таблица 17

Сполуки формули ІА.4', у яких  $R^2$  та  $R^3$  означають водень та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А



Таблиця 18

Сполуки формули ІА.4', у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають метил та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 19

Сполуки формули 1A.4', у яких  $R^2$  та  $R^3$  означають фтор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 20

Сполуки формули ІА.4', у яких  $R^2$  та  $R^3$  означають хлор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щонайменше одному рядку таблиці А.

Таблиця 21

Сполуки формули ІА.4', у яких  $R^2$  та  $R^3$  означають метокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 22

Сполуки формули ІА.4', у яких R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> означають трифторметокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 23

Сполуки формули ІА.5, у яких  $R^2$  означає метил та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А

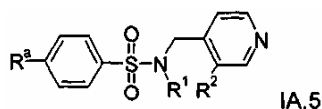


Таблица 24

Сполуки формули IA.5, у яких  $R^2$  означає фтор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці A.

Таблица 25

Сполуки формули ІА.5, у яких  $R^2$  означає хлор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 26

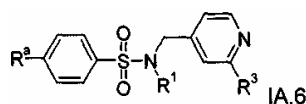
Сполуки формули ІА.5, у яких  $R^2$  означає метокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица 27

Сполуки формули ІА.5, у яких  $R^2$  означає трифторметокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 28

Сполуки формули ІА.6, у яких R<sup>3</sup> означає метил та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці А



Таблиця 29

Сполуки формули ІА.6, у яких  $R^3$  означає фтор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 30

Сполуки формули ІА.6, у яких  $R^3$  означає хлор та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 31

Сполуки формули ІА.6, у яких  $R^3$  означає метокси та комбінація з  $R^1$  та  $R^a$  відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблиця 32

Сполуки формули ІА.6, у яких R<sup>3</sup> означає тирфторметокси та комбінація з R<sup>1</sup> та R<sup>a</sup> відповідає щоразу одному рядку таблиці А.

Таблица А

N <sup>o</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>a</sup>
A-1	H	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>
A-2	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>
A-3	H	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-4	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-5	H	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
A-6	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
A-7	H	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> C≡CH
A-8	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> C≡CH
A-9	H	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CCl=CH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-10	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CCl=CH <sub>2</sub>
A-11	H	H
A-12	CH <sub>3</sub>	H
A-13	H	CH <sub>3</sub>
A-14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-15	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-16	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-17	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-19	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-20	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-21	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-22	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-24	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-25	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-26	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-27	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
A-28	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
A-29	H	OCH <sub>3</sub>
A-30	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
A-31	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-32	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-33	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-34	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-35	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-36	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-37	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-38	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-39	H	OCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-40	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-41	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-42	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
A-43	H	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-44	CH <sub>3</sub>	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
A-45	H	CCl <sub>3</sub>
A-46	CH <sub>3</sub>	CCl <sub>3</sub>
A-47	H	CHF <sub>2</sub>
A-48	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>
A-49	H	CF <sub>3</sub>
A-50	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
A-51	H	CHClF
A-52	CH <sub>3</sub>	CHClF
A-53	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
A-54	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
A-55	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-56	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-57	H	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-58	CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-59	H	OCHCl <sub>2</sub>
A-60	CH <sub>3</sub>	OCHCl <sub>2</sub>
A-61	H	OCCl <sub>3</sub>
A-62	CH <sub>3</sub>	OCCl <sub>3</sub>
A-63	H	OCH <sub>2</sub> F
A-64	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> F
A-65	H	OCHF <sub>2</sub>
A-66	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>
A-67	H	OCF <sub>3</sub>
A-68	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>
A-69	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
A-70	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
A-71	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-73	H	OCH <sub>2</sub> CHClF
A-74	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHClF
A-75	H	OCH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>
A-76	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>
A-77	H	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-78	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
A-79	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
A-80	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
A-81	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
A-82	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>

Сполуки формули I придатні для застосування як фунгіциди. Вони характеризуються гарною дією проти широкого спектра фітопатогенних грибів, зокрема з класу Ascomycetes, Deuteromycetes, Oomycetes та Basidiomycetes. Вони є системно активними та можуть застосовуватися як листяні та ґрунтові фунгіциди.

Вони мають особливе значення при боротьбі з великою кількістю грибів на різних культурних рослинах, таких, як пшениця, жито, ячмінь, овес, рис, кукурудза, дернина, банани, бавовник, соя, кава, цукрова тростина, виноградні лози, овочеві, плодові та декоративні культури, такі, як огірки, бобові, томати, картопля та гарбузові культури, а також на насінні цих рослин.

Зокрема, вони придатні для боротьби з наступними хворобами рослин:

- види *Alternaria* овочевих та плодівих культур,
- види *Bipolaris* та *Drechslera* на зернових, рисі та дернині,
- *Blumeria graminis* (справжня борошниста роса) на зернових,

- *Botrytis cinerea* (сіра гниль) на полуниці, овочевих культурах, декоративних рослинах та виноградних лозах,
- *Erysiphe cichoracearum* та *Sphaerotheca fuliginea* на гарбузових рослинах,
- види *Fusarium* та *Verticillium* на різних рослинах,
- види *Mycosphaerella* на зернових, бананах та земляному горі,
- *Phytophthora infestans* на картоплі та помідорах,
- *Plasmopara viticola* на виноградних лозах,
- *Podosphaera leucotricha* на яблунях,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* на пшениці та ячмені,
- види *Pseudoperonospora* на хмелі та огірках,
- види *Puccinia* на зернових,
- *Pyricularia oryzae* на рисі,
- види *Rhizoctonia* на бавовнику, рисі та дернині,
- *Septoria tritici* та *Stagonospora nodorum* на пшениці,
- *Uncinula necator* на виноградних лозах,
- види *Ustilago* на зернових та цукровій тростині, а також
- види *Venturia* (парша) на яблуневих та грушевих культурах.

Сполуки формули I придатні, крім того, для боротьби з патогенними грибами, такими, як *Raecilomyces variotii* при захисті матеріалів (наприклад, дерева, паперу, дисперсій для покриттів, волокон, відповідно, тканин) та при захисті запасів.

Сполуки формули I застосовуються таким чином, що гриби або рослини, посівний матеріал, матеріали або ґрунт, що підлягають захисту від ураження грибами, обробляють ефективною кількістю діючих речовин. Застосування можна здійснювати як перед, так і після інфікування грибами матеріалів, рослин або насіння.

Фунгіцидні засоби містять загалом від 0,1 до 95, бажано, від 0,5 до 90 мас. % діючої речовини.

Норми витрати при застосуванні для захисту рослин залежно від бажаного ефекту становлять від 0,01 до 2,0 кг діючої речовини на га.

При обробці насіннєвого матеріалу загалом потрібні кількості діючої речовини від 0,001 до 1 г, бажано, від 0,01 до 0,05 г на кг посівного матеріалу.

При застосуванні для захисту матеріалів, відповідно, запасів норми витрати діючої речовини орієнтуються на область застосування та бажаний ефект. Звичайні норми витрати при захисті матеріалів становлять, наприклад, від 0,001 г до 2 кг, переважно, від 0,005 г до 1 кг діючої речовини на кубічний метр оброблюваного матеріалу.

Сполуки формули I можна переводити у звичайні препаративні форми, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, тонкі порошки, порошки, пасти та грануляти. Застосування орієнтується на відповідну ціль застосування, у кожному разі воно повинно забезпечувати тонкий та рівномірний розподіл сполуки відповідно до винаходу.

Композиції відповідно до винаходу можна приготувати відомим чином, наприклад, розведенням діючої речовини розчинниками і/або

наповнювачами, за бажанням з застосуванням емульгаторів та диспергаторів. Як розчинники/допоміжні агенти придатні, зокрема:

- вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти Solvesso, ксилол), парафіни (наприклад, фракції сирої нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гамма-бутиролактон), піроліди (N-метилпіролідон, N-октилпіролідон), ацетати (глікольдіацетат), гліколі, амідиметиллових кислот жирного ряду, кислоти жирного ряду та складні ефіри кислот жирного ряду. В принципі можна застосовувати також і суміші розчинників;

- наповнювачі, такі, як природні гірські породи (наприклад, каоліни, глинозем, тальк, крейда) та синтетичні гірські породи (наприклад, високодисперсна кремнієва кислота, силікати); емульгатори, такі, як неіоногенні та аніонні емульгатори (наприклад, прості ефіри поліоксіетиленових спиртів жирного ряду, алкілсульфонати та арилсульфонати) та диспергатори, такі, як лігнінсульфітні відпрацьовані луги або метилцелюлоза.

Як поверхнево-активні речовини придатні лужні, лужноземельні, амонієві солі лігнінсульфофосфатів, фенолсульфофосфатів, нафталінсульфофосфатів, дибутілнафталінсульфофосфатів, алкіларилсульфонати, алкілсульфонати, алкілсульфати, сульфати спиртів жирного ряду, жирні кислоти та сульфатовані гліколеві ефіри спиртів жирного ряду, далі продукти конденсації сульфонованого нафталіну або його похідних з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну, відповідно нафталінсульфофосфатів з фенолом або формальдегідом, поліоксіетиленоктилфенольний ефір, етоксирований ізооктил фенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенолполігліколевий ефір, трибутилфенілполігліколевий ефір, тристерилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, конденсати етиленоксиду-спирту жирного ряду, етоксирована рицинова олія, поліоксіетиленалкіловий ефір або поліоксипропілен, поліглікольєфірний ацетат лаурилових спиртів, складний ефір сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луги або метилцелюлоза.

Для одержання розчинів, які розприскують безпосередньо, емульсій, паст або масляних дисперсій придатні фракції мінеральних масел з середньою - високою точкою кипіння, такі, як гас або дизельне масло, далі кам'яновугільні масла, а також масла (олії) рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні або ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

Порошок, препарат для розпилення та опудрювання можна одержати змішанням або спільним розмелом діючих речовин з твердим наповнювачем.



Гранулят, наприклад покритий, просочений або гомогенний, одержують звичайно за допомогою сполучення діючих речовин з твердим наповнювачем. Як тверді наповнювачі використовують, наприклад, мінеральні землі, такі, як силікагель, силікати, тальк, каолін, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію, розмелені пластмаси, а також такі добрива, як сульфати амонію, фосфати амонію, нітрати амонію, сечовини та рослинні продукти, такі, як наприклад борошно зернових культур, борошно деревної кори, деревне борошно та борошно горіхової шкарлупи, целюлозний порошок або інші тверді наповнювачі.

Готові препаративні форми містять загалом від 0,01 до 95мас.% бажано від 0,1 до 90мас.% діючої речовини. Діючі речовини застосовуються при цьому з чистотою від 90% до 100%, бажано від 95% до 100% (за спектром ЯМР).

Приклади препаративних форм:

1. Продукти для розведення у воді

A) Водорозчинні концентрати (SL)

10мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у воді або у водорозчинному розчиннику. Альтернативно додають змочувальний агент або інші допоміжні агенти. При розведенні у воді діюча речовина розчиняється.

B) Здатні до диспергування концентрати (DC)

20мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у циклогексаноні при додаванні диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. При розведенні у воді одержують дисперсію.

C) Здатні до емульгування концентрати (EC)

15мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі при додаванні Са-додецилбензолсульфонату та етоксилату рицинової олії (по 5% кожного). При розведенні у воді утворюється емульсія.

D) Емульсії (EW, EO)

40мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі при додаванні Са-додецилбензолсульфонату та етоксилату рицинової олії (по 5% кожного). Цю емульсію вводять у воду за допомогою емульгуючого пристрою (Ultraturax) і доводять до гомогенної емульсії. При розведенні у воді утворюється емульсія.

E) Суспензії (SC, OD)

20мас. частин сполуки відповідно до винаходу подрібнюють при додаванні диспергатора та змочувального агента і води або органічного розчинника у кульовому млині з мішалкою. При розведенні у воді утворюється стабільна суспензія діючої речовини.

F) Гранулят, який диспергується у воді, та розчинний у воді гранулят (WG, SG)

50мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють при додаванні диспергатора та змочувального агента і за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзійного пристрою, розпилювальної башти, псевдозрідженого шару) одержують гранулят, що диспергується у воді або розчиняється у воді. При розведенні у воді

утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої речовини.

G) Порошок, який диспергується у воді, та розчинний у воді порошок (WP, SP)

75мас. частин сполук відповідно до винаходу перемелюють при додаванні диспергатора та змочувального агента, а також силікагелю в роторно-статорному млині. При розведенні у воді утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої речовини.

2. Продукти для безпосереднього застосування

H) Порошки (DP)

5мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють і ретельно перемішують з 95% тонкого каоліну. У такий спосіб одержують засіб розпилювання.

I) Грануляти (GR, FG, GG, MG)

0,5мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють та зв'язують з 95,5% наповнювачів. Звичайним способом, який застосовують при цьому, є екструзія, розпилювальне сушіння або обробка у псевдозрідженому шарі. Одержують гранулят для безпосереднього застосування.

J) ULV-розчини (UL)

10мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють в органічному розчиннику, наприклад, ксилолі. Одержують продукт для безпосереднього застосування.

Діючі речовини можуть застосовуватися як такі, у формі своїх препаративних форм або у формах, що приготуються з них, наприклад, у формі призначених для безпосереднього обприскування розчинів, порошоків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, препаратів для обпилювання, препаратів для опудрювання або гранулятів і можуть застосовуватися шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилювання, опудрювання або поливу. Використовувані форми залежать від мети застосування, але у всіх випадках повинен бути забезпечений максимально тонкий і рівномірний розподіл діючих речовин за винаходом.

Водні композиції можуть бути приготовлені з концентратів емульсій, паст або змочувальних порошоків (порошки для розпилювання, масляні дисперсії) шляхом додавання води. Для одержання емульсій, паст або масляних дисперсій речовини можна як такі або розчинені в маслі або розчиннику гомогенізувати у воді за допомогою змочувальних агентів, адгезійних складів, диспергаторів або емульгаторів. Також можуть бути приготовлені концентрати, які придатні для розведення водою та які складаються з діючих речовин і змочувальних агентів, адгезійних складів, диспергаторів або емульгаторів або масла.

Концентрації діючих речовин у композиціях можуть варіюватися в широкому діапазоні. Загалом такі концентрації становлять від 0,0001 і до 10%, краще від 0,01 і до 1%.

Діючі речовини можуть також застосовуватися з великим успіхом відповідно до способу з низькими об'ємами застосування Ultra-Low-Volume

(ULV), причому можливе застосування композицій з більш ніж 95мас.% діючої речовини або навіть діючої речовини без домішок.

До діючих речовин можна домішувати масла різних типів, змочувальні агенти, домішки, гербіциди, фунгіциди, інші засоби захисту від шкідників, бактерициди, в разі потреби безпосередньо перед застосуванням (суміш у баці). Ці засоби можуть домішуватися до засобів відповідно до винаходу у масовому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

Засоби відповідно до винаходу можуть у формі застосування як фунгіциди знаходитися разом з іншими діючими речовинами, наприклад, з гербіцидами, інсектицидами, регуляторами росту, фунгіцидами або також з добривами. При змішуванні сполук формули I, відповідно засобів, що їх містять у формі застосування як фунгіциди з іншими фунгіцидами одержують у багатьох випадках збільшення фунгіцидного спектра дії.

Наступний перелік фунгіцидів, разом з якими можуть застосовуватися сполуки відповідно до винаходу, наведений для пояснення можливостей комбінювання, не обмежуючи їх:

- ацилаланіни, такі, як беналаксил, металаксил, офураце або оксадиксил,

- похідні аміну, такі, як альдиморф, додин, додеморф, фенпропіморф, фенпропідин, гуазатин, іміноктадин, спіроксамін або тридеморф,

- аніліноліримідини, такі, як піриметаніл, мепаніпірим або циродиніл,

- антибіотики, такі, як циклогексимід, гризеофульвін, казугаміцин, натаміцин, поліоксин або стрептоміцин,

- азоли, такі, як бітертанол, бромоназол, ципроконазол, дифеноконазол, динітроконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флуквіконазол, флузілазол, гексаконазол, імазаліл, метконазол, міклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, прохлорац, протіконазол, тебуконазол, триадимефон, триадименол, трифлумізол або трітконазол,

- дикарбоксиміди, такі, як іпродіон, міклозолін, процімідон або вінклозолін,

- дитіокарбамати, такі, як фербам, набам, манеб, манкозєб, метам, метирам, пропінеб, полікарбамат, тирам, зирам або зинеб,

- гетероциклічні сполуки, такі, як анілазин, беноміл, боскалід, карбендазим, карбоксин, оксикарбоксин, ціазофамід, дазомет, дитіанон, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фуберідазол, флутоланіл, фураметпір, ізопротіолан, мепроніл, нуаримол, пробеназол, проквіназид, пірифенокс, піроквілон, квіноксифен, силтіофам, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тіадиніл, трициклазол або трифорин,

- мідьвмісні фунгіциди, такі, як бордоська рідина, ацетат міді, оксихлорид міді, гідроксид міді, оксид міді, основний сульфат міді, оксихлорид-сульфат міді,

- нітрофенілові похідні, такі як бінапакрил, динокап, динобутон, нітрофтал-ізопропіл,

- фенілпроли, такі, як фенгіклоніл або флудіоксоніл,

- сірка,

- інші фунгіциди, такі, як ацибензолар-S-метил, бентіавалякарб, карпропамід, хлороталоніл, цифлуфенамід, цимоксаніл, дазомет, дикломезин, диклоцимет, діетофенкарб, едифенфос, етабоксам, фенгексамід, фентин-ацетат, феноксаніл, феримзон, флузінам, фосетил, фосетил-алюміній, іпроталікарб, гексахлорбензол, метрафенон, пенцикурон, пропамонакарб, фталід, толклофос-метил, квінтоцен або зоксамід,

- стробілури, такі, як азоксистробін, димоксистробін, флуоксистробін, крезоксим-метил, метоміностробін, орисастробін, піоксистробін, піраклостробін або трифлуксистробін,

- похідні сульфенової кислоти й аналогів, такі, як каптафол, каптан, дихлофлуанід, фолпет або толілфлуанід,

- аміді коричневої кислоти й аналогів, такі, як диметоморф, флуметовер або флуморф.

Приклади синтезу

Показані в нижченаведених прикладах синтезу стадії використовуються при відповідній зміні вихідних сполук для одержання інших сполук формули I. Одержані таким чином сполуки представлені в нижченаведених таблицях з фізичними даними.

Приклад 1. Одержання 4-ацетил-N-піридин-4-ілметилфенілсульфон-аміду

До розчину 10г (45,7ммоль) хлориду 4-ацетилсульфофосфору в 150мл діетилацетату по краплях додають 1мл піридину при -10°C, розчин 4,95г (45,7ммоль) 4-(амінометил)-піридину (4-піколіламіну) в 10мл діетилацетату; потім розчин перемішують при 20-25°C приблизно 18 годин. Продукт відсмоктують, залишок промивають розведеним NaHCO<sub>3</sub>-розчином та водою, потім сушать. Одержують 5,2г зазначеної в заголовку сполуки з Тпл. 162-167°C.

Приклад 2. Одержання 4-(1-етоксііміноетил)-N-піридин-4-іл-метилфенілсульфонаміду

Розчин 0,4г (1,3ммоль) сполуки з прикладу 1 в 20мл метанолу змішують з 0,42г 40%-вого водного розчину О-етилгідроксиламіну. За допомогою 10%-вої соляної кислоти реакційну суміш підкисляють до значення pH 4, потім розчин перемішують при 20-25°C приблизно 18 годин. Реакційну суміш виливають на воду та встановлюють pH на 8 за допомогою NaHCO<sub>3</sub>. Потім реакційну суміш екстрагують метил-трет-бутиловим ефіром і зібрані органічні фази промивають водою та сушать. Після видалення розчинника одержують 0,4г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді в'язкоплинної маси.

<sup>1</sup>H-ЯМР (δ, CDCl<sub>3</sub>): 8,5 (d, 2H); 7,5 (m, 4H); 7,1 (d, 2H); 5,0 (t, 1H); 4,25 (q, 2H); 4,1 (d, 2H); 2,25 (s, 3H); 1,3 (t, 3H).

Приклад 3. Одержання 4-(1-етоксііміноетил)-N-метил-N-піридин-4-іл-метилфенілсульфонаміду

Суспензію 0,04г (1,32ммоль) NaN (95%) в 50мл диметилформаміду (DMF) змішують з 0,4г (1,2ммоль) сполуки з прикладу 2, потім перемішують при 20-25°C впродовж 10 хвилин. Після цього до реакційної суміші прикрплюють розчин 0,17г (1,2ммоль) йодметану в 10мл диметилформаміду, зібраний реакційний розчин перемішують при 20-25°C приблизно 18 годин,

вливають на воду, потім екстрагують метил-трет-бутиловим ефіром. Зібрані органічні фази промивають водою і потім сушать. Після видалення розчинника одержують 0,3г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді в'язкоплинного масла.

<sup>1</sup>H-ЯМР (δ, CDCl<sub>3</sub>): 8,6 (d, 2H); 7,8 (m, 4H); 7,25 (d, 2H); 4,25 (q, 2H); 4,1 (d, 2H); 2,6 (s, 3H); 2,25 (s, 3H); 1,25 (t, 3H).

Таблиця І



№	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Фіз. дані (Тпл, °C); <sup>1</sup> H-ЯМР [млн. ч.]; МС m/e [M+H <sup>+</sup> ]
I-1	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,0 (3H); 2,25 (3H)
I-2	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,25 (3H); 1,3 (3H)
I-3	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	5,2 (2H); 4,7 (2H); 4,05 (2H); 2,25 (3H)
I-4	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	4,45 (1H); 4,2 (2H); 2,25 (3H); 1,3 (6H)
I-5	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	4,8 (2H); 4,2 (2H); 2,5 (1H); 2,3 (3H)
I-6	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,1 (2H); 2,25 (3H); 0,9 (3H)
I-7	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	5,3 (2H); 4,25 (2H); 2,25 (3H)
I-8	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,05 (3H); 2,65 (3H); 2,25 (3H)
I-9	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,7 (3H); 1,35 (3H)
I-10	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	4,3 (2H); 4,2 (2H); 3,2 (2H); 2,2 (3H); 1,3 (3H); 0,9 (3H)
I-11	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	H	H	4,35 (2H); 4,25 (2H); 4,0 (2H); 2,25 (1H)
I-12	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	4,3 (2H); 4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,25 (3H)
I-13	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	5,5 (1H); 5,0 (2H); 4,3 (2H); 3,75 (2H)
I-14	4-COOCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,45 (1H); 8,0 (1H); 7,4 (1H); 4,5 (2H)
№	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Фіз. дані (Тпл, °C); <sup>1</sup> H-ЯМР [млн. ч.]; МС m/e [M+H <sup>+</sup> ]
I-15	4-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 7,3 (1H); 4,65 (2H); 1,3 (6H)
I-16	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 4,6 (1H); 3,0 (1H); 1,3 (6H)
I-17	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 333
I-18	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 367
I-19	1-нафтил	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 349
I-20	2-CH <sub>2</sub> -6-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 381
I-21	2-Cl-5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 363
I-22	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 367
I-23	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 324
I-24	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 367
I-25	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 379
I-26	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 367
I-27	3,4-(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 358
I-28	2-CH <sub>2</sub> -6-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 347
I-29	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 333
I-30	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,45 (1H); 8,0 (1H); 7,4 (1H); 4,5 (2H)
I-31	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 7,3 (1H); 4,65 (2H); 1,3 (6H)
I-32	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 4,6 (1H); 3,0 (1H); 1,3 (6H)
I-33	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,75 (1H); 8,0 (1H); 5,8 (1H); 4,7 (2H)
№	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Фіз. дані (Тпл, °C); <sup>1</sup> H-ЯМР [млн. ч.]; МС m/e [M+H <sup>+</sup> ]
I-34	4-OCF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,8 (1H); 4,7 (2H)
I-35	4-COOCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,8 (1H); 7,3 (1H); 4,6 (2H); 2,6 (3H)
I-36	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,2 (NH); 4,6 (2H); 4,0 (3H); 2,2 (3H)
I-37	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,0 (NH); 4,6 (2H); 4,3 (3H); 2,3 (3H); 1,35 (3H)
I-38	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,1 (NH); 4,6 (2H); 4,5 (3H); 2,25 (3H); 1,3 (6H)
I-39	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,3 (NH); 5,2 (2H); 4,75 (2H); 4,6 (2H); 2,35 (3H)
I-40	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,1 (NH); 4,8 (2H); 4,6 (2H); 2,5 (2H); 2,3 (3H)
I-41	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,2 (NH); 4,6 (2H); 4,2 (2H); 2,25 (2H); 0,9 (3H)
I-42	4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	5,3 (2H); 5,2 (NH); 4,8 (2H); 2,3 (3H)
I-43	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	4,6 (2H); 2,7 (3H)
I-44	5-хлорфеніл	H	H	H	H	H	m/e 339
I-45	тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	m/e 305
I-46	5-[(4-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )-тіофен-2-іл]	H	H	H	H	H	166
I-47	5-Br-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	148
№	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Фіз. дані (Тпл, °C); <sup>1</sup> H-ЯМР [млн. ч.]; МС m/e [M+H <sup>+</sup> ]
I-48	4-NO <sub>2</sub> -5-Cl-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	182
I-49	5-Cl-1,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -1H-піразол-4-іл	H	H	H	H	H	147
I-50	3-Br-2,5-Cl <sub>2</sub> -тіофен-4-іл	H	H	H	H	H	106
I-51	1-CH <sub>2</sub> -1H-мідазол-4-іл	H	H	H	H	H	125
I-52	5-(4-трет-бутилфеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	166
I-53	5-хлор-1,3-диметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	H	H	147
I-54	5-бромтіофен-2-іл	H	H	H	H	H	148
I-55	5-хлор-4-нітрофеніл-2-іл	H	H	H	H	H	182
I-56	1-метил-1H-мідазол-4-іл	H	H	H	H	H	125
I-57	4-бром-2,5-дихлорфеніл-3-іл	H	H	H	H	H	106
I-58	5-біфеніл-4-іл-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	204
I-59	5-(4-трифторметоксифеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	138
I-60	5-(4-пропілфеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	144
I-61	5-(4-етилфеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	144
I-62	5-(3-трифторметилфеніл)-тіофеніл	H	H	H	H	H	130

№	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Фіз. дані (Тпл, °C); <sup>1</sup> H-ЯМР [млн. ч.]; МС m/e [M+H <sup>+</sup> ]
I-63	5-(4-хлорофеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	176
I-64	5-(4-трифторметилфеніл)-тіофеніл	H	H	H	H	H	165
I-65	5-(4-метоксифеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	175
I-66	5-(4-трифторметилфеніл)-тіофен-2-іл	пропаргіл	H	H	H	H	116
I-67	5-(4-трифторметилфеніл)-тіофен-2-іл	н-пропіл	H	H	H	H	97
I-68	5-(4-трифторметилфеніл)-тіофен-2-іл	метил	H	H	H	H	101
I-69	5-(4-ізопропілфеніл)-тіофен-2-іл	H	H	H	H	H	125
I-70	5-бромтіофен-2-іл	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	137
I-71	5-(4-трифторметилфеніл)-тіофен-2-іл	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	180
I-72	4-трет-бутилфеніл	метил	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	145-148

Приклади дії проти патогенних грибів

Фунгіцидну дію сполук формули І можна показати за допомогою наступних експериментів:

Діючі речовини приготовляють окремо або спільно як основний розчин з 0,25мас.% діючої речовини в ацетоні або диметилсульфоксиді. До цього розчину додають 1мас.% емульгатора Unipero® EL (змочувальний агент з емульгувальною та диспергуючою дією на базі етоксированих алкілфенолів) і розбавляють водою до бажаної концентрації.

Приклад застосування 1 - Ефективність проти альтернаріозної бурі плямистості томатів, що викликана *Alternaria solani*

Листки вирощених у горщиках рослин сорту "Goldene Prinzessin" обприскують водною суспензією у нижченаведеній концентрації діючої речовини до утворення крапель. Наступного дня листки інфікують водною суспензією спор *Alternaria solani* в 2% солодовому розчині з густиною 0,17×10<sup>6</sup>спор/мл. Після цього рослини поміщають у насичену водним паром камеру при температурі між 20 та 22°C. Через 5 днів хвороба на необроблених, однак інфікованих контрольних рослинах розвилася настільки сильно, що можна було візуально визначити ураження у %.

У цьому досліді оброблені за допомогою 250млн.ч. діючої речовини I-2 - I-6, I-14, I-15, I-17, I-30 - I-34, I-36 - I-42, відповідно, I-45 рослини мали ураження не більше 30%, у той час як необроблені рослини були уражені на 100%.

Приклад застосування 2 - Ефективність проти борошнистої роси на листках огірків, що викликана *Sphaerotheca fuliginea* при захисному застосуванні

Листя вирощених у горщиках паростків огірків сорту "Chinesische Schlange" обприскують на фазі сім'ядоль водною суспензією у нижче наведеній концентрації діючої речовини до утворення крапель. Через 20 годин після підсихання напρισканого шару рослини інокулюють водною суспензією спор борошнистої роси огірків (*Sphaerotheca fuliginea*). Після цього рослини культивують у теплиці при температурі між 20 та 24°C та відносній вологості повітря від 60 до 80% протягом 7 днів. Потім візуально визначають ступінь розвитку борошнистої роси у % ураження на поверхні зародкових листків.

У цьому експерименті оброблені за допомогою 250млн.ч. діючої речовини I-1 - I-5, I-15, I-18, I-30, I-32, I-33, I-34, I-37 - I-40, I-42, відповідно, I-45 рослини виявили ураження не більше ніж 30%, у той час як необроблені рослини були уражені на 100%.